

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 8 月 11 日 (11.08.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/073210 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 307/85,
307/86, 405/14, 413/14, 405/12, 409/12, 413/12, 491/113,
A61K 31/343, 31/5377, 31/496, 31/4025, 31/497, 31/41,
31/438, 31/357, 31/381, 31/422, 31/443, 31/35, 31/4525,
31/423, 31/4178, 31/5377, 31/4439, 31/4725, 31/4035,
31/55, A61P 9/10, 25/14, 25/24, 25/28

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/001168

(22) 国際出願日: 2005 年 1 月 21 日 (21.01.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2004-19235 2004 年 1 月 28 日 (28.01.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): キッセイ薬品工業株式会社 (KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒399-8710 長野県 松本市 芳野 1 9 番 4 8 号 Nagano (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中村 哲也 (NAKAMURA, Tetsuya) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 塩原 寛明 (SHIOHARA, Hiroaki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 寺尾 嘉洋 (TERAO, Yoshihiro) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 中山 聡子

(NAKAYAMA, Satoko) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 宮澤 敬治 (MIYAZAWA, Keiji) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 大野田 秀樹 (OHNOTA, Hideki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇郡 穂高町 大字 柏原 4 3 6 5-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

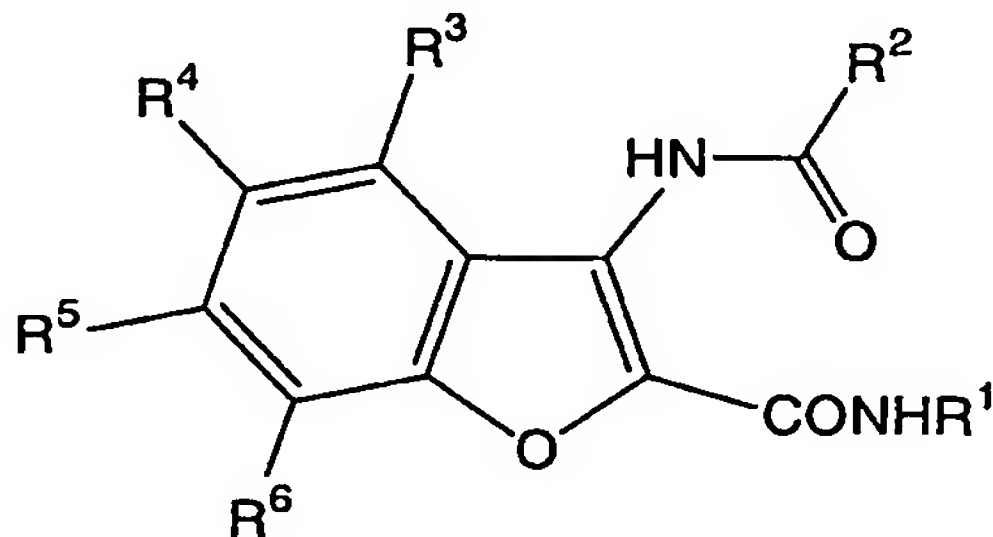
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: NOVEL BENZOFURAN DERIVATIVE, MEDICINAL COMPOSITION CONTAINING THE SAME, AND USES OF THESE

(54) 発明の名称: 新規なベンゾフラン誘導体、それを含有する医薬組成物およびそれらの用途



(I)

(57) Abstract: A compound represented by the general formula (I) [wherein R¹ represents hydrogen or lower alkyl; R² represents lower alkyl, halo(lower alkyl), cycloalkyl, heterocycloalkyl, aryl, aralkyl, arylalkenyl, aryloxy(lower alkyl), heteroaryl, heteroaryl(lower alkyl), etc.; and R³, R⁴, R⁵, and R⁶ each represents hydrogen, halogeno, cyano, lower alkyl, halo(lower alkyl), lower alkoxy, hydroxy, aryl, etc.; provided that at least one of R³, R⁴, R⁵, and R⁶ is not hydrogen] or a prodrug or pharmacologically acceptable salt of the compound. The compound (I) has excellent

antagonistic activity against an adenosine A_{2A} receptor and is hence useful as a therapeutic or preventive agent for diseases related to an adenosine A_{2A} receptor, especially motor dysfunctions, depression, anxiety disorders, cognition dysfunctions, cerebral ischemic disorders, restless legs syndromes, etc.

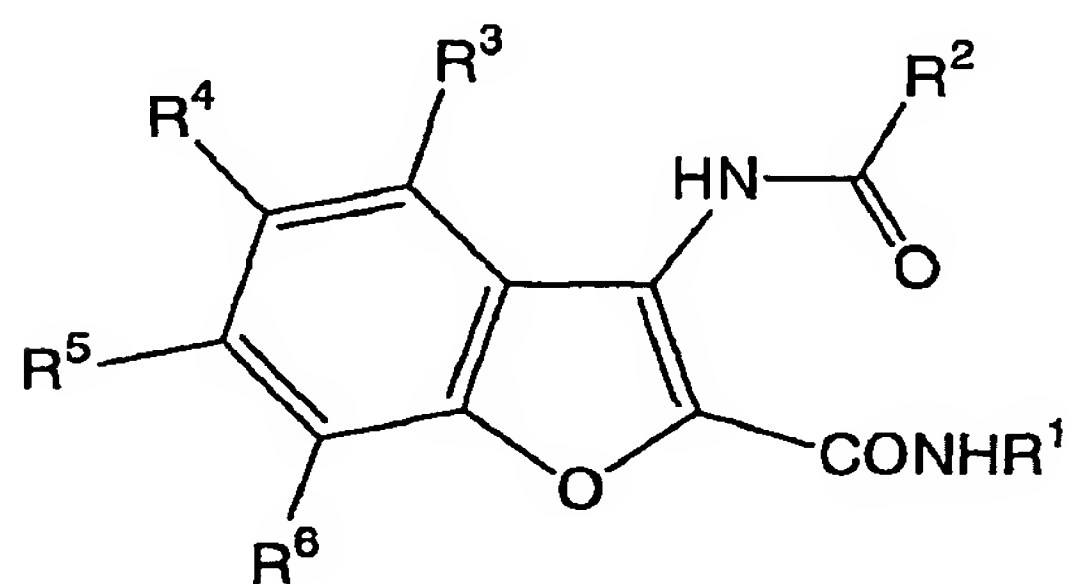
[続葉有]

WO 2005/073210 A1



(57) 要約:

本発明は、一般式（I）〔式中、 R^1 は水素または低級アルキルであり； R^2 は低級アルキル、ハロ低級アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アラルキル、アリールアルケニル、アリールオキシ低級アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール低級アルキル等であり； R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 はそれぞれ水素、ハロゲン、シアノ、低級アルキル、ハロ低級アルキル、低級アルコキシ、水酸基、アリール等であり；但し、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 の少なくとも一つは水素以外である〕で表される化合物またはそのプロドラッグ、あるいは薬理学的に許容される塩に関する。本発明の化合物（I）は、優れたアデノシン A_{2A} 受容体拮抗作用を有するので、アデノシン A_{2A} 受容体関連疾患、特に運動機能障害、うつ病、不安症、認知機能障害、脳虚血性障害、レストレスレッグス症候群などの治療または予防剤として有用である。

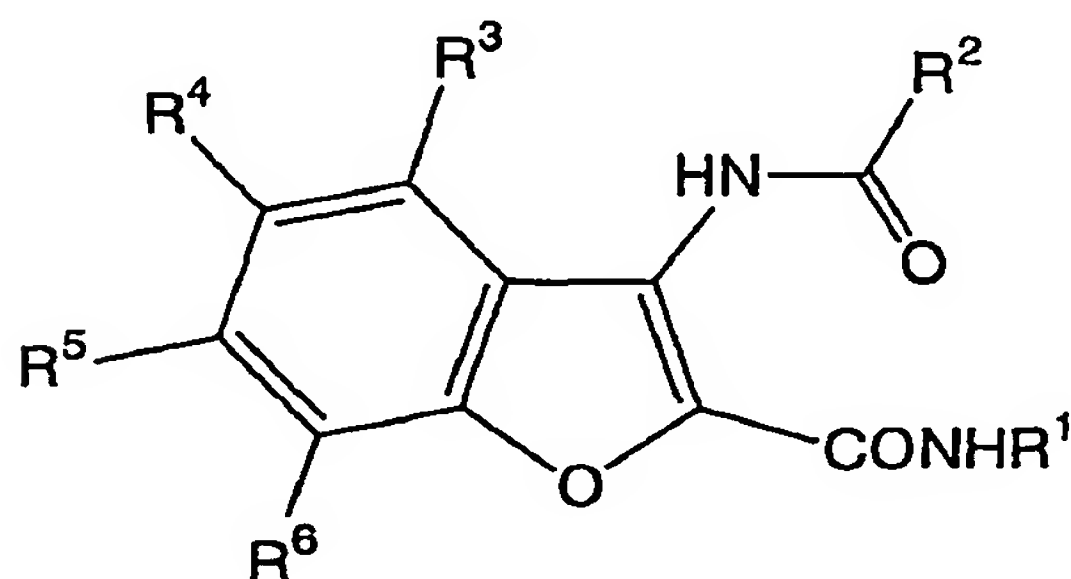


(I)



(57) 要約:

本発明は、一般式（I）〔式中、 R^1 は水素または低級アルキルであり； R^2 は低級アルキル、ハロ低級アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アラルキル、アリールアルケニル、アリールオキシ低級アルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリール低級アルキル等であり； R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 はそれぞれ水素、ハロゲン、シアノ、低級アルキル、ハロ低級アルキル、低級アルコキシ、水酸基、アリール等であり；但し、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 の少なくとも一つは水素以外である〕で表される化合物またはそのプロドラッグ、あるいは薬理学的に許容される塩に関する。本発明の化合物（I）は、優れたアデノシン A_{2A} 受容体拮抗作用を有するので、アデノシン A_{2A} 受容体関連疾患、特に運動機能障害、うつ病、不安症、認知機能障害、脳虚血性障害、レストレスレッグス症候群などの治療または予防剤として有用である。



(I)